PCT





## INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internati nale Patentklassifikati n 7:

A1

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer:

WO 00/64415

A61K 9/20

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum:

2. November 2000 (02.11.00)

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP00/03612

(22) Internationales Anmeldedatum:

20. April 2000 (20.04.00)

(30) Prioritätsdaten:

199 18 325.2

22. April 1999 (22.04.99)

DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): EURO-CELTIQUE S.A. [LU/LU]; 122, Boulevard de la Petrusse, L-2330 Luxemburg (LU).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): REIN, Hubert [DE/DE]; (DE). STEFFENS, Klaus-Jürgen [DE/DE]; Hommelsheimstrasse 9-11, D-53359 Rheibach/Flerzheim (DE).

(74) Anwalt: MAIWALD, Walter, Maiwald Patentanwalts-GmbH, Elisenhof, Elisenstrasse 3, D-80335 München (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

## Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist; Veröffentlichung wird wiederholt falls Anderungen eintreffen.

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING A WATER-INSOLUBLE AMORPHOUS OR PARTIALLY AMORPHOUS CONTROLLED RELEASE MATRIX

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG EINER WASSERUNLÖSLICHEN AMORPHEN ODER TEILAMORPHEN RETARDMATRIX

## (57) Abstract

13

The invention relates to a method for producing pharmaceutical forms or preliminary stages thereof by means of extrusion. The pharmaceutical form has a matrix in which the active agent is contained essentially, and whose essential characteristics are determined by the extrusion process and which comprises a polysaccharide and/or a derivative thereof and/or a complex thereof and/or any mixture of the aforementioned substances with other substances and/or saccharides and/or derivatives thereof as an essential constituent, and at least one pharmaceutically active substance. The invention also relates to a pharmaceutical form which has a matrix in which the active agent is contained essentially, and whose essential characteristics are determined by the extrusion process, and which comprises a polysaccharide and/or a derivative thereof and/or a complex thereof and/or any mixture of the aforementioned substances with other substances and/or saccharides and/or derivatives thereof as an essential constituent, and at least one pharmaceutically active substance. Finally, the invention also relates to the use of said pharmaceutical form for producing granulates for tabletting and filling capsules, for further processing using injection moulding techniques and as an auxiliary material for direct tabletting and/or for producing monobloc pharmaceutical forms.

## (57) Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung von Arzneiformen oder Vorstufen davon mittels Extrusion, wobei die Arzneiform eine den Wirkstoffgehalt im wesentlichen enthaltende Matrix aufweist, die in ihren wesentlichen Eigenschaften durch die Extrusion ausgebildet wird, und ein Polysaccharid und/oder ein Derivat davon und/oder einen Komplex davon und/oder eine beliebige Mischung der vorgenannten Substanzen mit anderen Substanzen und/oder Sacchariden und/oder Derivaten davon als wesentlichen Bestandteil der Matrix sowie mindestens eine pharmazeutisch wirksame Substanz umfasst. Die Erfindung betrifft weiterhin eine Arzneiform, welche eine den Wirkstoffgehalt im wesentlichen enthaltende Matrix, die in ihren wesentlichen Eigenschaften durch Extrusion ausgebildet ist, und ein Polysaccharid und/oder ein Derivat davon und/oder einen Komplex davon und/oder eine beliebige Mischung der vorgenannten Substanzen mit anderen Substanzen und/oder Sacchariden und/oder Derivaten davon als wesentlichen Bestandteil der Matrix sowie mindestens ine pharmazeutisch wirksame Substanz umfasst. Weiter betrifft die Erfindung die Verwendung der Arzneiform zur Herstellung von Granulaten für die Tablettierung und Kapselfüllung, zur Weiterverarbeitung mit Spritzgussverfahren, als Hilfsstoff bei der Direkttablettierung und/od r zur Herstellung von M noblockarzneiformen.